

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2003 年 4 月 3 日 (03.04.2003)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 03/027077 A1

(51) 国際特許分類: C07D 237/14, A61K  
31/50, 31/501, A61P 37/02, 29/00, 9/00, 19/10, 31/04,  
29/00, 19/02, 1/04, 43/00

朝霞市栄町 459-16 Saitama (JP). 佐藤 精一 (SATO, Sei-  
ichi); 〒167-0043 東京都 杉並区上荻 4丁目 4-1-202  
Tokyo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/09863

(74) 代理人: 特許業務法人アルガ特許事務所 (THE  
PATENT CORPORATE BODY ARUGA PATENT  
OFFICE); 〒103-0013 東京都 中央区日本橋人形町 1  
丁目 3番 6号 共同ビル Tokyo (JP).

(22) 国際出願日: 2002 年 9 月 25 日 (25.09.2002)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ: 60/324,569 2001 年 9 月 26 日 (26.09.2001) US

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,  
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,  
DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,  
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,  
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO,  
NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL,  
TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA,  
ZM, ZW.

(71) 出願人: 興和株式会社 (KOWA CO., LTD.) [JP/JP]; 〒  
460-8625 愛知県 名古屋市中区錦 三丁目 6 番 2 9 号  
Aichi (JP).

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW,  
MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許  
(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ  
特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR,  
GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI 特  
許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR,  
NE, SN, TD, TG).

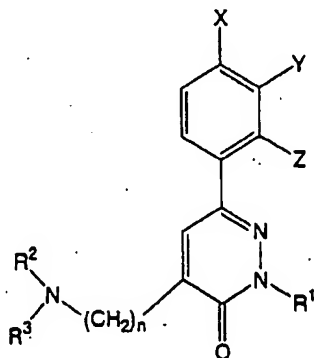
(72) 発明者: 京谷 善徳 (KYOTANI, Yoshinori); 〒207-0021  
東京都 東大和市立野 3丁目 1293-10-2-112 Tokyo (JP).  
古志 朋之 (KOSHI, Tomoyuki); 〒353-0006 埼玉県 志  
木市館 2丁目 4-4-206 Saitama (JP). 執行 洋陸 (SHI-  
GYO, Hiromichi); 〒183-0035 東京都 府中市四谷 6丁  
目 18-18 Tokyo (JP). 吉崎 栄男 (YOSHIZAKI, Hideo); 〒  
350-1315 埼玉県 狭山市北入曾 459-16 Saitama (JP). 北  
村 崇博 (KITAMURA, Takahiro); 〒189-0001 東京都 東  
村山市秋津町 1丁目 25-7 Tokyo (JP). 竹村 俊司 (TAKE-  
MURA, Shunji); 〒192-0045 東京都 八王子市大和田町  
5丁目 31-18 Tokyo (JP). 安岡 京子 (YASUOKA, Kyoko);  
〒207-0012 東京都 東大和市新堀 3丁目 19-3-305 Tokyo  
(JP). 戸塚 順子 (TOTSUKA, Junko); 〒351-0012 埼玉県

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される  
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語  
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: WATER-SOLUBLE PHENYLPYRIDAZINE DERIVATIVES AND DRUGS CONTAINING THE SAME

(54) 発明の名称: 水溶性フェニルピリダジン誘導体及びこれを含有する医薬



(57) Abstract: Compounds represented by the following general formula (1), which have an effect of inhibiting IL- $\beta$  production, are highly soluble in water and have a favorable oral absorbability, and medicinal compositions containing the same: (1) wherein R<sup>1</sup> represents alkyl, alkenyl, etc.; R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup> represent each hydrogen, alkyl, hydroxyalkyl, dihydroxyalkyl or alkynyl, or R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup> may form together with the adjacent nitrogen atom an optionally substituted nitrogen-containing saturated heterocyclic group; X, Y and Z represent each hydrogen, alkyl, halogeno, etc.; and n is from 1 to 5.

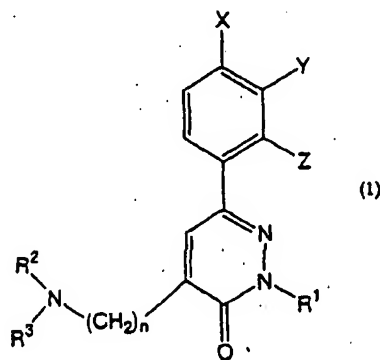
[続案有]

WO 03/027077 A1



(57) 要約:

本発明は一般式 (1)



(式中、R<sup>1</sup>は、アルキル、アルケニル基等を示し；

R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>は、それぞれ水素原子、アルキル基、ヒドロキシアルキル基、ジヒドロキシアルキル基又はアルキニル基を示すが、R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が隣接する窒素原子と一緒にあって、置換基を有していてもよい含窒素飽和複素環式基を形成してもよく；

X、Y及びZは水素、アルキル、ハロゲン等を示し；nは1～5の数を示す)  
で表される化合物及びこれを含む医薬組成物に関する。IL-1β産生抑制作用を有し、水溶性が高く、かつ経口吸収性が良好である。